

505, 146  
10/505146

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
28. August 2003 (28.08.2003)

PCT

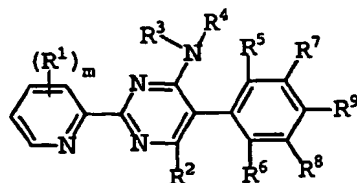
(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 03/070721 A1

- (51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: C07D 401/04, (72) Erfinder; und  
A01N 43/54 (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): SCHIEWECK, Frank  
[DE/DE]; Lindenweg 4, 67258 Hessheim (DE). TORMO  
I BLASCO, Jordi [ES/DE]; Mühlweg 47, 67117  
(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP03/01162 Limburgerhof (DE). GROTE, Thomas [DE/DE]; Im  
Hoehenhausen 18, 67157 Wachenheim (DE). GYPSEr,  
(22) Internationales Anmeldedatum: Andreas [DE/DE]; B 4 4, 68159 Mannheim (DE).  
6. Februar 2003 (06.02.2003) MÜLLER, Bernd [DE/DE]; Stockingerstrasse 7,  
(25) Einreichungssprache: Deutsch 67227 Frankenthal (DE). RHEINHEIMER, Joachim  
(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch [DE/DE]; Merziger Strasse 24, 67063 Ludwigshafen  
(30) Angaben zur Priorität: (DE). ROSE, Ingo [DE/DE]; C 2, 19, 68159 Mannheim  
102 07 428.3 21. Februar 2002 (21.02.2002) DE (DE). SCHÄFER, Peter [DE/DE]; Römerstrasse 1, 67308  
102 10 136.1 8. März 2002 (08.03.2002) DE Ottersheim (DE). GRAMMENOS, Wassilios [GR/DE];  
(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme Samuel Hahnemann Weg 9, 67071 Ludwigshafen (DE).  
von US): BASF AKTIENGESSELLSCHAFT [DE/DE]; GEWEHR, Markus [DE/DE]; Goethestrasse 21, 56288  
67056 Ludwigshafen (DE). SCHWÖGLER, Anja [DE/DE]; Kastellaun (DE). BLET-  
TNER, Carsten [DE/DE]; An der Mittagsweide 59,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: 2-(2-PYRIDYL)-5-PHENYL-6-AMINOPYRIMIDINE, METHOD AND INTERMEDIATE PRODUCTS FOR THE  
PRODUCTION AND USE THEREOF FOR COMBATING NOXIOUS FUNGI

(54) Bezeichnung: 2-(2-PYRIDYL)-5-PHENYL-6-AMINOPYRIMIDINE, VERFAHREN UND ZWISCHENPRODUKTE ZU  
IHRER HERSTELLUNG UND IHRE VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN



(I)

(57) Abstract: The invention relates to 2-(2-pyridyl)-5-phenyl-6-aminopyrimidines of formula I, wherein the substitutes and the index have the following meaning: R<sup>1</sup> represents halogen, hydroxy, hyano, hxo, nitro, amino, mercapto, alkyl, halogenalkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, alkoxy, halogenalkoxy, carbonyl, alkoxy, carbonyl, carbamoyl, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, morpholinocarbonyl, pyrrolidinocarbonyl, alkylcarbonylamino, alkylamino, dialkylamino, alkylthio, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, hydroxysulfonyl, aminosulfonyl, alkylaminosulfonyl, dialkylaminosulfonyl; m = 0 or 1 - 4; R<sup>2</sup>

represents hydrogen, halogen, cyano, alkyl, halogenalkyl or alkoxy; R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> represents hydrogen, alkyl, halogenalkyl, cycloalkyl, halogenocycloalkyl, alkenyl, halogenalkenyl, cycloalkenyl, alkynyl, halogenalkynyl or cycloalkynyl, R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> together with the nitrogen atom to which they are connected, form a five or six-membered ring which is interrupted by an atom from the group O, N or S and/or can be substituted according to the description; R<sup>5</sup> represents halogen, alkyl or halogenalkyl; R<sup>6</sup> represents hydrogen or one of the known groups in R<sup>5</sup>; R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> represent hydrogen, halogen, alkyl or halogenalkyl; R<sup>9</sup> represents hydrogen, halogen, hydroxy, cyano, alkyl, alkoxy, cycloalkoxy, halogenalkoxy, alkoxy, carbonyl or alkylaminocarbonyl. The invention also relates to a method and intermediate product for the production of said compound in addition to the use thereof for combating undesirable plants.

(57) Zusammenfassung: 2-(2-Pyridyl)-5-phenyl-6-aminopyrimidine der Formel I, in der die Substituenten und der Index folgende Bedeutung haben: R<sup>1</sup> Halogen, Hydroxy, Cyano, Oxo, Nitro, Amino, Mercapto, Alkyl, Halogenalkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Carboxyl, Alkoxy, Carbonyl, Carbamoyl, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Morpholinocarbonyl, Pyrrolidinocarbonyl, Alkylcarbonylamino, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Hydroxysulfonyl, Aminosulfonyl, Alkylaminosulfonyl, Dialkylaminosulfonyl; m = 0 oder 1 bis 4; R<sup>2</sup> Wasserstoff, Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl oder Alkoxy; R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Halogenocycloalkyl, Alkenyl, Halogenalkenyl, Cycloalkenyl, Alkynyl, Halogenalkynyl oder Cycloalkynyl, R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch ein Atom aus der Gruppe O, N oder S unterbrochen sein und/oder gemäss der Beschreibung substituiert sein kann; R<sup>5</sup> Halogen, Alkyl oder Halogenalkyl; R<sup>6</sup> Wasserstoff oder eine der bei R<sup>5</sup> genannten Gruppen; R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> Wasserstoff, Halogen, Alkyl oder Halogenalkyl; R<sup>9</sup> Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano, Alkyl, Alkoxy, Cycloalkoxy, Halogenalkoxy, Alkoxy, Carbonyl oder Alkylaminocarbonyl; Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung dieser Verbindungen sowie deren Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen.

BEST AVAILABLE COPY



67065 Ludwigshafen (DE). **AMMERMANN, Eberhard** [DE/DE]; Von-Gagem-Strasse 2, 64646 Heppenheim (DE). **STRATHMANN, Siegfried** [DE/DE]; Donnersbergstrasse 9, 67117 Limburgerhof (DE). **LORENZ, Gisela** [DE/DE]; Erlenweg 13, 67434 Hambach (DE). **STIERL, Reinhard** [DE/DE]; Ginsterstrasse 17, 67112 Mutterstadt (DE).

(74) **Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGESSELLSCHAFT**; 67056 Ludwigshafen (DE).

(81) **Bestimmungsstaaten (national)**: AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) **Bestimmungsstaaten (regional)**: ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

**Veröffentlicht:**

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

*Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.*

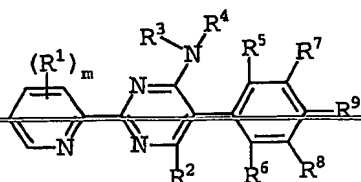
2-(2-Pyridyl)-5-phenyl-6-aminopyrimidine, Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen

5

# Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft 2-(2-Pyridyl)-5-phenyl-6-aminopyrimidine der Formel I,

10



15

in der die Substituenten und der Index folgende Bedeutung haben:

- R<sup>1</sup> Halogen, Hydroxy, Cyano, Oxo, Nitro, Amino, Mercapto, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, Carboxyl, C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-Alkoxycarbonyl, Carbamoyl, C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-Alkylaminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylaminocarbonyl, Morpholinocarbonyl, Pyrrolidinocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-Alkylcarbonylamino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, Hydroxysulfonyl, Aminosulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminosulfonyl, Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)aminosulfonyl;
- m 0, 1, 2, 3 oder 4;
- R<sup>2</sup> Wasserstoff, Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy;
- R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenocycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkynyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkynyl,
- R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch ein Atom aus der Gruppe O, N oder S unterbrochen sein und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl oder Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen kann oder in dem zwei benachbarte C-Atome oder ein N- und ein benach-

## 2

bartest C-Atom durch eine C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylenkette verbunden sein können;

R<sup>5</sup> Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl;

5

R<sup>6</sup> Wasserstoff oder eine der bei R<sup>5</sup> genannten Gruppen;

R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl;

10

R<sup>9</sup> Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, ~~C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminocarbonyl.~~

15 Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung dieser Verbindungen sowie deren Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen.

2-Pyridylaminopyrimidin-Derivate mit fungizider Wirkung sind aus  
20 EP-A 407 899 allgemein bekannt. Sie sind als Pflanzenschutzmittel gegen Schadpilze geeignet.

Ihre Wirkung ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend. Daher lag als Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter

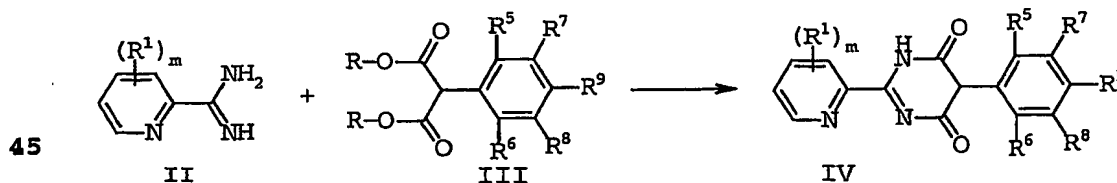
25 Wirksamkeit zu finden.

Demgemäß wurden die eingangs definierten Phenylpyrimidinderivate I gefunden. Außerdem wurden Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung sowie sie enthaltende Mittel zur Bekämpfung von  
30 Schadpilzen und ihre Verwendung in diesem Sinne gefunden.

Die Verbindungen der Formel I weisen eine gegenüber den bekannten Verbindungen erhöhte Wirksamkeit gegen Schadpilze auf.

35 Die Verbindungen I unterscheiden sich von den bekannten Verbindungen durch die Substitution des 5-Phenylringes, in der mindestens ein Orthosubstituent nicht Wasserstoff ist.

Verbindungen der Formel I sind beispielsweise nach folgendem Syn-  
40 theseweg zugänglich,



## 3

wobei in Formel III R für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl steht. Die Reaktion erfolgt üblicherweise in einem protischen Lösungsmittel wie z.B. Alkoholen, insbesondere Ethanol. Sie kann aber auch in aprotischen Lösungsmitteln wie z.B. Pyridin, N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, oder Mischungen aus diesen durchgeführt werden. Die Reaktion wird üblicherweise bei 50 bis 250°C, vorzugsweise bei 100 bis 200°C durchgeführt [vgl.: Austr. J. Chem., Bd. 32, S. 669-679 (1979); J. Org. Chem., Bd. 58, S. 3785-3786 (1993); Arm. Xim. ZH, Bd. 38, N11, 718-719 (1985)].

10

In der Regel ist es vorteilhaft, in Gegenwart einer Base zu arbeiten, die äquimolar oder auch in Überschuß angewendet werden kann. Als Basen kommen Alkalimetall- und Erdalkalimetallalko-

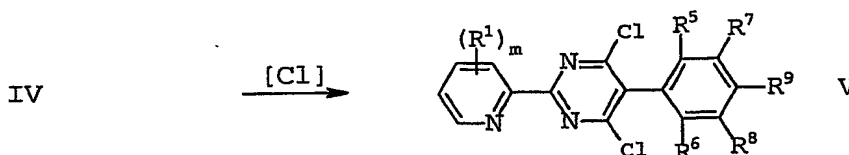
late wie Natriummethanolat, Natriumethanolat, Kaliummethanolat, Kalium-tert.-Butanolat, insbesondere Natriumethylat oder auch Stickstoffbasen, wie Triethylamin, Tri-isopropylethylamin und N-Methylpiperidin, insbesondere Pyridin und Tributylamin in Frage.

20 Üblicherweise werden die Komponenten in etwa stöchiometrischen Mengen eingesetzt. Es kann jedoch auch vorteilhaft sein eine der Komponenten im Überschuß einzusetzen.

Die Ausgangsstoffe der Formeln II und III sind in der Literatur bekannt [vgl. EP-A 588 146; EP-A 10 02 788; WO-A 98/41496], z. T. auch kommerziell erhältlich oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.

Verbindungen IV werden in die Dichlorpyrimidine der Formel V überführt [vgl. US 4,963,678; EP-A 745 593; DE-A 196 42 533; WO-A 99/32458; J. Org. Chem. Bd. 58, S. 3785-3786 (1993); Helv. Chim. Acta, Bd. 64, S. 113-152 (1981)].

35



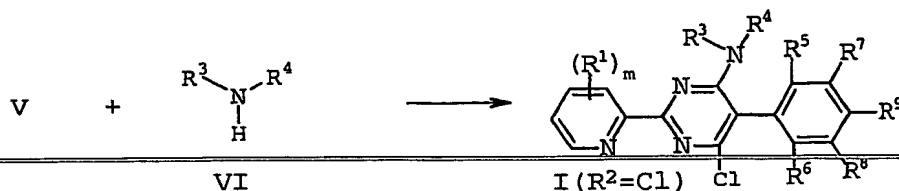
Als Chlorierungsmittel [Cl] eignen sich beispielsweise POCl<sub>3</sub>, PCl<sub>3</sub>/Cl<sub>2</sub> oder PCl<sub>5</sub>, oder Mischungen dieser Reagenzien. Die Reaktion kann in überschüssigem Chlorierungsmittel (POCl<sub>3</sub>) oder einem inerten Lösungsmittel, wie beispielsweise Acetonitril oder 1,2-Dichlorethan durchgeführt werden. Die Durchführung in POCl<sub>3</sub> ist bevorzugt.

45

## 4

Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise zwischen 10 und 180°C. Aus praktischen Gründen entspricht gewöhnlich die Reaktionstemperatur der Siedetemperatur des eingesetzten Chlorierungsmittels (POCl<sub>3</sub>) oder des Lösungsmittels. Das Verfahren wird vorteilhaft unter Zusatz von N,N-Dimethylformamid in katalytischen oder unterstöchiometrischen Mengen oder von Stickstoffbasen, wie beispielsweise N,N-Dimethylaminilin durchgeführt.

10



15 Durch Aminierung mit VI werden die Dichlorverbindungen der Formel V in die Verbindungen der Formel I, in der R<sup>2</sup> für Chlor steht, überführt.

Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei 0 bis 150°C, vorzugsweise bei 20 bis 120°C [vgl. J. Chem. Res. S (7), S. 286-287 (1995), Liebigs Ann. Chem., S. 1703-1705 (1995)] in einem inerten Lösungsmittel gegebenenfalls in Gegenwart einer Hilfsbase.

Als Lösungsmittel kommen protische Lösungsmittel, wie Alkohole, beispielsweise Ethanol, oder aprotische Lösungsmittel, wie aromatische Kohlenwasserstoffe oder Ether, beispielsweise Toluol, o-, m- und p-Xylol, Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan oder Tetrahydrofuran, insbesondere tert. Butylmethylether oder Tetrahydrofuran, in Frage. Als Hilfsbase kommen beispielsweise die im folgenden genannten in Betracht: NaHCO<sub>3</sub>, Na<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>, Na<sub>2</sub>HPO<sub>4</sub>, Na<sub>2</sub>B<sub>4</sub>O<sub>7</sub>, Diethylanilin oder Ethyldiisopropylamin.

Üblicherweise werden die Komponenten in etwa stöchiometrischem Verhältnis eingesetzt. Es kann jedoch vorteilhaft sein, das Amin im Überschuß einzusetzen.

Die Amine der Formel VI sind käuflich oder literaturbekannt oder können nach bekannten Methoden hergestellt werden.

40 Verbindungen der Formel I, in der R<sup>2</sup> für Alkoxy steht, werden aus den entsprechenden Chlorverbindungen der Formel I, in der R<sup>2</sup> für Chlor steht, durch Umsetzung mit Alkali- oder Erdalkalimetallalkoholaten erhalten [vgl.: Heterocycles, Bd. 32, S. 1327-1340 (1991); J. Heterocycl. Chem. Bd. 19, S. 1565-1567 (1982); Gete-  
45 rotsikl. Soedin, S. 400-402 (1991)].

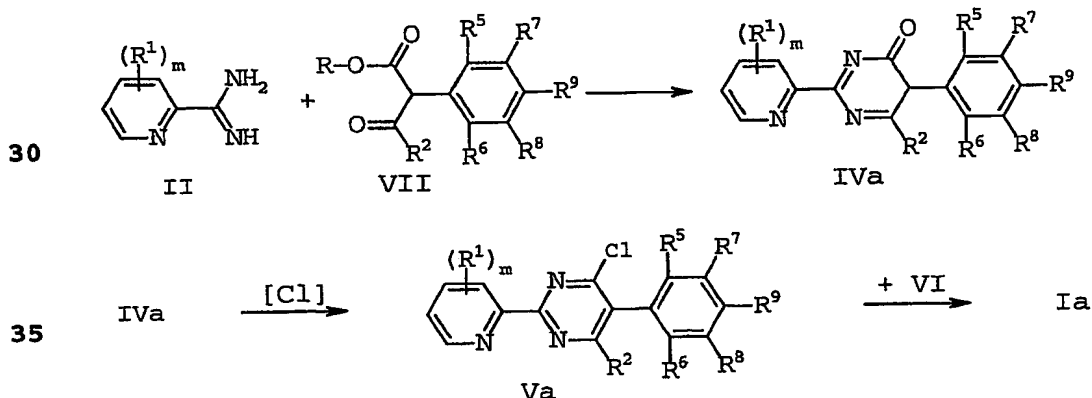
## 5

Verbindungen der Formel I, in der R<sup>2</sup> für Cyano steht, werden aus den entsprechenden Chlorverbindungen der Formel I (R<sup>2</sup> = Cl) durch Umsetzung mit Alkali-, Erdalkalimetall- oder Metallcyaniden, wie NaCN, KCN oder Zn(CN)<sub>2</sub>, erhalten [vgl.: Heterocycles, Bd. 39, S. 345-356 (1994); Collect. Czech. Chem. Commun. Bd. 60, S. 1386-1389 (1995); Acta Chim. Scand., Bd. 50, S. 58-63 (1996)].

Verbindungen der Formel I, in der R<sup>2</sup> für Wasserstoff steht, werden aus den entsprechenden Chlorverbindungen der Formel I (R<sup>2</sup> = Cl) durch katalytische Hydrierung erhalten [vgl.: J. Fluorine Chem. Bd. 45, S. 417-430 (1989); J. Heterocycl. Chem. Bd. 29, S. 1369-1370 (1992)], oder durch Reduktion mit Zink in Essigsäure [vgl.: Org. Prep. Proced. Int., Bd. 27, S. 600-602 (1995); JP-A 09/165 379].

15

Verbindungen der Formel I, in der R<sup>2</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl steht (Formel Ia), lassen sich durch entsprechende Abwandlung der Ausgangsmaterialien der Formel III analog der beschriebenen Synthesefolge zu den Verbindungen I, in der R<sup>2</sup> Chlor bedeutet, herstellen. Anstatt der Phenylmalonester der Formel III werden Phenyl-β-ketoester der Formel VII, in der R<sup>2</sup> Alkyl oder Halogenalkyl bedeutet, mit dem Amidin der Formel II eingesetzt. Die folgenden Umsetzungen werden analog der vorstehend beschriebenen Synthesen zu den Verbindungen mit R<sup>2</sup> = Chlor durchgeführt.



Die Verbindungen der Formeln IVa und Va sind neu.

40 Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen- und Endprodukte fallen z.T. in Form farbloser oder schwach bräunlicher, zäher Öle an, die unter vermindertem Druck und bei mäßig erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gereinigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe

## 6

erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.

5 Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

**Halogen:** Fluor, Chlor, Brom und Jod;

---

**Alkyl:** gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen, z.B. C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

**Halogenalkyl:** geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, z.B. C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl und 1,1,1-Trifluorprop-2-yl;

**Alkenyl:** ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl,



## 7

- 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 5 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 15 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

- Alkynyl:** geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 30 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

- 35 **Cycloalkyl:** monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6 Kohlenstoffringgliedern, wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl;

- Alkoxy-carbonyl:** eine Alkoxygruppe mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

- Oxyalkylenoxy:** divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH<sub>2</sub>-Gruppen, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH<sub>2</sub>O, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O und OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O;

## 8

Die besonders bevorzugten Ausführungsformen der Zwischenprodukte in Bezug auf die Variablen entsprechen denen der Reste  $R^1$  bis  $R^9$  der Formel I.

5 Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der 2-Pyridylpyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt:

10 Verbindungen I werden besonders bevorzugt, in denen  $m = 0$  ist.

Daneben werden Verbindungen I bevorzugt, in denen  $m = 1$  oder 2  
~~ist und  $R^1$  folgende Bedeutung hat:~~

15 Halogen, Hydroxy, Cyano, Nitro, Amino, Mercapto,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkynyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy, Carboxyl,  $C_1$ - $C_7$ -Alkoxycarbonyl, Carbamoyl,  $C_1$ - $C_7$ -Alkylaminocarbonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl- $C_1$ - $C_6$ -alkylamincarbonyl, Morpholinocarbonyl, Pyrrolidinocarbonyl,  $C_1$ - $C_7$ -Alkylcarbonylamino,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylamino, 20 Di-( $C_1$ - $C_6$ -alkyl)amino,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfonyl, Hydroxysulfonyl, Aminosulfonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylaminosulfonyl oder Di-( $C_1$ - $C_6$ -alkyl)aminosulfonyl.

25 Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen  $R^1$  ausgewählt ist aus der Gruppe:

Halogen, Cyano, Nitro, Amino,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy, Carboxyl,  $C_1$ - $C_7$ -Alkoxycarbonyl, Carbamoyl, 30  $C_1$ - $C_7$ -Alkylaminocarbonyl, Di-( $C_1$ - $C_6$ -alkyl)amincarbonyl oder  $C_1$ - $C_7$ -Alkylcarbonylamino.

Bevorzugt werden weiterhin Verbindungen I, in denen  $m = 1$  ist und  $R^1$  für Halogen, Cyano, Nitro, Methyl oder Methoxy steht.

35

Insbesondere sind Verbindungen I bevorzugt, in denen  $R^1$  Fluor, Chlor oder Methyl bedeutet.

Verbindungen I werden bevorzugt, in denen  $R^2$  für Halogen,

40  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy, insbesondere für Halogen, steht.

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel I, in der  $R^2$  Chlor bedeutet.

45 Außerdem werden Verbindungen der Formel I bevorzugt, in denen  $R^3$  für Wasserstoff steht.

## 9

Gleichermaßen besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> unabhängig voneinander C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl bedeuten.

- 5 Insbesondere werden Verbindungen der Formel I bevorzugt, in denen R<sup>3</sup> für Wasserstoff und R<sup>4</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl steht.

Weiterhin werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen  
 10 fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch ein Heteroatom unterbrochen sein kann und einen oder zwei C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsubstituenten tragen kann.

Gleichermaßen besonders bevorzugt werden Verbindungen I, in denen  
 15 R<sup>5</sup> Halogen oder Methyl und R<sup>6</sup> Wasserstoff bedeuten.

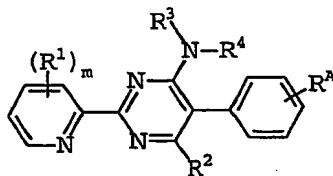
Besonders bevorzugt werden Verbindungen I, in denen R<sup>6</sup> Wasserstoff bedeutet.

- 20 Desweiteren werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R<sup>7</sup> und R<sup>8</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder Halogen bedeuten.

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R<sup>9</sup>  
 25 für Wasserstoff, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminocarbonyl steht.

Gleichermaßen besonders bevorzugt sind Verbindungen I', in denen R<sup>1</sup> bis R<sup>4</sup> wie für Formel I definiert sind und R<sup>A</sup> für folgende Re-  
 30 stekombinationen steht: 2-Methyl, 4-Fluor, 2-Fluor, 4-Methyl, 2,4-Dimethyl, 2-Chlor, 6-Fluor; 2,6-Difluor; 2,6-Dichlor; 2-Methyl, 6-Fluor; 2,4,6-Trifluor; 2,6-Difluor, 4-Methoxy und Pentafluor.

35



I'

40

Darüberhinaus werden Verbindungen der Formel I' besonders bevorzugt, in denen R<sup>A</sup> 2,4,6-Trifluor bedeutet.

Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den fol-  
 45 genden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in

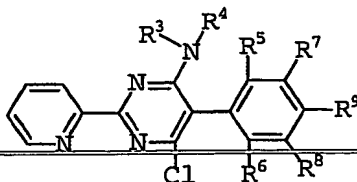
10

der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.

## Tabelle 1

- 5 Verbindungen der Formel I-1, in denen R<sup>5</sup> für Fluor, R<sup>6</sup> für Chlor und R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> für Wasserstoff stehen und die Kombination der Reste R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10



I-1

15

## Tabelle 2

Verbindungen der Formel I-1, in denen R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> für Fluor und R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> für Wasserstoff stehen und die Kombination der Reste R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-

20 spricht

## Tabelle 3

Verbindungen der Formel I-1, in denen R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> für Chlor und R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> für Wasserstoff stehen und die Kombination der Reste R<sup>3</sup>

- 25 und R<sup>4</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 4

Verbindungen der Formel I-1, in denen R<sup>5</sup> für Fluor und R<sup>6</sup> für Methyl und R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> für Wasserstoff stehen und die Kombination der Reste R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 5

- 35 Verbindungen der Formel I-1, in denen R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> und R<sup>9</sup> für Fluor und R<sup>7</sup> und R<sup>8</sup> für Wasserstoff stehen und die Kombination der Reste R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 6

Verbindungen der Formel I-1, in denen R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> für Fluor, R<sup>7</sup> und R<sup>8</sup> für Wasserstoff und R<sup>9</sup> für Methoxy stehen und die Kombination der Reste R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

## 11

## Tabelle 7

Verbindungen der Formel I-1, in denen R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> für Fluor stehen und die Kombination der Reste R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 8

Verbindungen der Formel I-1, in denen R<sup>5</sup> für Methyl, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> und R<sup>8</sup> für Wasserstoff und R<sup>9</sup> für Fluor stehen und die Kombination der Reste R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Ta-

10 belle A entspricht

## Tabelle 9

~~Verbindungen der Formel I-1, in denen R<sup>5</sup> für Fluor, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> und R<sup>8</sup>~~  
für Wasserstoff und R<sup>9</sup> für Methyl stehen und die Kombination der  
15 Reste R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Ta-  
belle A entspricht

## Tabelle 10

Verbindungen der Formel I-1, in denen R<sup>5</sup> und R<sup>9</sup> für Methyl und R<sup>6</sup>,  
20 R<sup>7</sup> und R<sup>8</sup> für Wasserstoff stehen und die Kombination der Reste R<sup>3</sup>  
und R<sup>4</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-  
spricht

## Tabelle 11

25 Verbindungen der Formel I-1, in denen R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> für Fluor, R<sup>7</sup> und  
R<sup>8</sup> für Wasserstoff, R<sup>9</sup> für Hydroxy stehen und die Kombination der  
Reste R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Ta-  
belle A entspricht

30 Tabelle A

No.	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
A-1	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-2	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
35 A-3	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-4	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-5	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-6	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
40 A-7	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-8	CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> F	H
A-9	CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> F	CH <sub>3</sub>
A-10	CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> F	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
45 A-11	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
A-12	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-13	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>


## 12

No.	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
A-14	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-15	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	H
5	A-16	CH <sub>3</sub>
	A-17	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-18	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
10	A-19	H
	A-20	CH <sub>3</sub>
	A-21	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-22	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-23	H
15	A-24	CH <sub>3</sub>
	A-25	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-26	H
	A-27	CH <sub>3</sub>
	A-28	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
20	A-29	H
	A-30	CH <sub>3</sub>
	A-31	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-32	H
	A-33	CH <sub>3</sub>
25	A-34	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-35	H
	A-36	CH <sub>3</sub>
	A-37	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-38	H
30	A-39	CH <sub>3</sub>
	A-40	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-41	H
	A-42	CH <sub>3</sub>
	A-43	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
35	A-44	H
	A-45	CH <sub>3</sub>
	A-46	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-47	H
	A-48	CH <sub>3</sub>
40	A-49	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-50	H
	A-51	CH <sub>3</sub>
	A-52	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>

## 13

No.	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
A-53	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-54	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
5 A-55	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-56	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-57	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-58	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
10 A-59	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-60	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-61	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
<del>A-62</del>	<del>(S) CH(CH<sub>3</sub>)-CF<sub>3</sub></del>	<del>H</del>
A-63	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
15 A-64	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-65	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-66	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-67	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
20 A-68	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-69	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-70	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-71	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
25 A-72	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-73	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-74	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H
A-75	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-76	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
30 A-77	Cyclopentyl	H
A-78	Cyclopentyl	CH <sub>3</sub>
A-79	Cyclopentyl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-80	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	
35 A-81	(±) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-82	(R) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-83	(S) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-84	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
40 A-85	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-86	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]-CH <sub>2</sub> -	
A-87	-CH <sub>2</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub> -	
A-88	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	
45 A-89	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-90	(±) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-91	(R) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	

## 14

No.	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
A-92	(S) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-93	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(O[CH <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> O)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
5 A-94	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(O[CH <sub>2</sub> ] <sub>3</sub> O)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-95	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  -CH <sub>2</sub> -	
A-96	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub> -	
A-97	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
10 A-98	-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-99	(cis) -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-100	(trans) -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-101	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
15 A-102	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-103	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-104	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHF-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-105	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CHF-CH <sub>2</sub> -	
20 A-106	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CF <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-107	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>2</sub> F)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-108	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CF <sub>2</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der *Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Phycomyceten* und *Basidiomyceten*, aus. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
- *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
- *Cercospora arachidicola* an Erdnüssen,
- *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
- *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
- *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,



## 15

- Helminthosporium-Arten an Getreide,
- Mycosphaerella-Arten an Bananen und Erdnüssen,
- Phytophthora infestans an Kartoffeln und Tomaten,
- Plasmopara viticola an Reben,
- 5 • Podosphaera leucotricha an Äpfeln,
- Pseudocercospora herpotrichoides an Weizen und Gerste,
- Pseudoperonospora-Arten an Hopfen und Gurken,
- Puccinia-Arten an Getreide,
- Pyricularia oryzae an Reis,
- 10 • Rhizoctonia-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- Septoria nodorum an Weizen,
- Uncinula necator an Reben,

---

- ~~Ustilago-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie~~
- Venturia-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

## 15

Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie Paecilomyces variotii im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

## 20

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der

- 25 Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

## 30

Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

- 35 Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 0,1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich

- 40 die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effektes. Übliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

- 45 Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich

## 16

nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

- 5 Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln, wobei im Falle von Wasser als Verdünnungsmittel auch andere organische Lösungsmittel als Hilfs-
- 10 lösungsmittel verwendet werden können. Als Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht: Lösungsmittel wie Aromaten (z.B. Xylol), chlorierte Aromaten (z.B. Chlorbenzole), Paraffine (z.B. ~~Erdölfraktionen~~), ~~Alkohole (z.B. Methanol, Butanol)~~, ~~Ketone (z.B. Cyclohexanon)~~, Amine (z.B. Ethanolamin, Dimethylformamid) und Was-
- 15 ser; Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nicht-ionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergier-
- 20 mittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

- Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Al-
- 25 kylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate und Fettsäuren sowie deren Alkali- und Erdalkalisalze, Salze von sulfatiertem Fettalkoholglykoether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit
- 30 Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykoether, Tributylphenylpolyglykoether, Alkylarylpolyletheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxy-
- 35 liertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoetheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

- Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen von mittle-
- 40 rem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol,
- 45 Butanol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B.

## 17

Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, Wasser, in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder ge-  
5 meinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe  
10 hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde,  
~~Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunst-~~  
stoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat,  
15 Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95  
20 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Beispiele für Formulierungen sind:

25

I. 5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 95 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 5 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

30

II. 30 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit einer Mischung aus 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde, innig vermischt. Man  
35 erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit (Wirkstoffgehalt 23 Gew.-%).

40

III. 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 90 Gew.-Teilen Xylol, 6 Gew.-  
Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 2 Gew.-Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 2 Gew.-Teilen des Anlage-  
45 rungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 9 Gew.-%).

45

## 18

- IV. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 60 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 16 Gew.-%).
- 5
- V. 80 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalin- $\alpha$ -sulfonsäure, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 7 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer ~~Hammermühle vermahlen (Wirkstoffgehalt 80 Gew.-%).~~
- 10
- 15 VI. Man vermischt 90 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung mit 10 Gew.-Teilen N-Methyl- $\alpha$ -pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist (Wirkstoffgehalt 90 Gew.-%).
- 20 VII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 25
- 30 VIII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalin- $\alpha$ -sulfonsäure, 17 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 35

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem

40

45

## 19

Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

- Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten  
5 oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden.  
10 Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.
- 

- 15 Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.
- 20 Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.
- 25 Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.
- 30 Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen  
35 I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.  
Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die  
40 Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:
- Schwefel, Dithiocarbamate und deren Derivate, wie Ferridimethyldithiocarbamat, Zinkdimethyldithiocarbamat, Zinkethylenbisdithiocarbamat, Manganethylenbisdithiocarbamat, Mangan-Zinkethylen-diamin-bis-dithiocarbamat, Tetramethylthiuramdisulfide,
- 45 Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N-ethylen-bis-dithiocarbamat), Am-

## 20

- moniak-Komplex von Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiocarbamat), Zink-(N,N'-propylenbis-dithiocarbamat), N,N'-Polypropylen-bis-(thiocarbamoyl)disulfid;
- Nitroderivate, wie Dinitro-(1-methylheptyl)-phenylcrotonat,
  - 5 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-3,3-dimethylacrylat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-isopropylcarbonat, 5-Nitro-isophthalsäure-di-isopropylester;
  - heterocyclische Substanzen, wie 2-Heptadecyl-2-imidazolin-acetat, 2,4-Dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin, O,O-Diethyl-
  - 10 phthalimidophosphonothioat, 5-Amino-1-[bis-(dimethylamino)-phosphinyl]-3-phenyl-1,2,4-triazol, 2,3-Dicyano-1,4-dithioanthrachinon, 2-Thio-1,3-dithiolo[4,5-b]chinoxalin,
  - ~~1-(Butylcarbamoyl)-2-benzimidazol-carbaminsäuremethylester,~~
  - 2-Methoxycarbonylamino-benzimidazol, 2-(Furyl-(2))-benz-
  - 15 imidazol, 2-(Thiazolyl-(4))-benzimidazol, N-(1,1,2,2-Tetrachlorethylthio)-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-phthalimid,
  - N-Dichlorfluormethylthio-N',N'-dimethyl-N-phenyl-schwefelsäurediamid, 5-Ethoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol, 2-Rhodanme-
  - 20 thylthiobenzthiazol, 1,4-Dichlor-2,5-dimethoxybenzol, 4-(2-Chlorphenylhydrazono)-3-methyl-5-isoxazonon, Pyridin-2-thio-1-oxid, 8-Hydroxychinolin bzw. dessen Kupfersalz, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid,
  - 25 2-Methyl-5,6-dihydro-4H-pyran-3-carbonsäure-anilid, 2-Methylfuran-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,4,5-Trimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäurecyclohexylamid, N-Cyclohexyl-N-methoxy-2,5-dimethyl-furan-3-carbonsäureamid, 2-Methyl-benzoesäure-
  - 30 re-anilid, 2-Iod-benzoesäure-anilid, N-Formyl-N-morpholin-2,2,2-trichlorethylacetal, Piperazin-1,4-diylbis-1-(2,2,2-trichlorethyl)-formamid, 1-(3,4-Dichloranilino)-1-formylamino-2,2,2-trichlorethan, 2,6-Dimethyl-N-tridecyl-morpholin bzw. dessen Salze, 2,6-Dimethyl-N-cyclododecyl-morpholin bzw. dessen Salze, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-cis-2,6-dimethyl-morpholin, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-piperidin, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-ethyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol,
  - 40 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-n-propyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol, N-(n-Propyl)-N-(2,4,6-trichlorphenoxyethyl)-N'-imidazol-yl-harnstoff, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanon, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanol, (2RS,3RS)-1-[3-(2-Chlorphenyl)-2-(4-fluorphenyl)-oxiran-2-ylmethyl]-1H-1,2,4-triazol,  $\alpha$ -(2-Chlorphenyl)- $\alpha$ -(4-chlorphenyl)-5-pyrimidin-methanol, 5-Butyl-2-dimethylamino-4-hydro-
  - 45

## 21

- xy-6-methyl-pyrimidin, Bis-(p-chlorphenyl)-3-pyridinmethanol, 1,2-Bis-(3-ethoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol, 1,2-Bis-(3-methoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol,
- Strobilurine wie Methyl-E-methoxyimino-[ $\alpha$ -(o-tolyloxy)-o-tolyl]acetat, Methyl-E-2-(2-[6-(2-cyanophenoxy)-pyrimidin-4-yl]-oxy)-phenyl-3-methoxyacrylat, Methyl-E-methoxyimino-[ $\alpha$ -(2-phenoxyphenyl)]-acetamid, Methyl-E-methoxyimino-[ $\alpha$ -(2,5-dimethylphenoxy)-o-tolyl]-acetamid, Methyl-E-2-(2-[2-trifluormethylpyridyl-6-]oxymethyl)-phenyl-3-methoxyacrylat, (E,E)-Methoximino-{2-[1-(3-trifluormethylphenyl)-ethylidenamino]oxymethyl-phenyl}-essigsäuremethylester, Methyl-N-(2-{[1-(4-chlorphenyl)-1H-pyrazol-3-yl]oxymethyl}phenyl)-N-methoxy-carbammat,

---

  - Anilinopyrimidine wie N-(4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl)-anilin, N-[4-Methyl-6-(1-propinyl)-pyrimidin-2-yl]-anilin, N-[4-Methyl-6-cyclopropyl-pyrimidin-2-yl]-anilin,
  - Phenylpyrrole wie 4-(2,2-Difluor-1,3-benzodioxol-4-yl)-pyrrol-3-carbonitril,
  - Zimtsäureamide wie 3-(4-Chlorphenyl)-3-(3,4-dimethoxyphenyl)-acrylsäuremorpholid,
  - sowie verschiedene Fungizide, wie Dodecylguanidinacetat, 3-[3-(3,5-Dimethyl-2-oxycyclohexyl)-2-hydroxyethyl]-glutarimid, Hexachlorbenzol, DL-Methyl-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-N-furoyl(2)-alaninat, DL-N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-(2'-methoxyacetyl)-alanin-methyl-ester, N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-chloracetyl-
  - 25 D,L-2-aminobutyrolacton, DL-N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-(phenylacetyl)-alaninmethylester, 5-Methyl-5-vinyl-3-(3,5-dichlorphenyl)-2,4-dioxo-1,3-oxazolidin, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-5-methyl-5-methoxymethyl-1,3-oxazolidin- 2,4-dion, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-1-isopropylcarbamoylhydantoin, N-(3,5-Dichlor-
  - 30 phenyl)-1,2-dimethylcyclopropan-1,2-dicarbonsäureimid, 2-Cyano-[N-(ethylaminocarbonyl)-2-methoximino]-acetamid, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-pentyl]-1H-1,2,4-triazol, 2,4-Difluor- $\alpha$ -(1H-1,2,4-triazolyl-1-methyl)-benzhydrylalkohol, N-(3-Chlor-2,6-dinitro-4-trifluormethyl-phenyl)-5-trifluormethyl-3-chlor-2-
  - 35 aminopyridin, 1-((bis-(4-Fluorphenyl)-methylsilyl)-methyl)-1H-1,2,4-triazol, Iprovalicarb, Benthiavalicarb, Proquinazid, 5-Chlor-2-cyano-4-p-tolyl-imidazol-1-sulfonsäuredimethylamid, 3,5-Dichlor-N-(3-chlor-1-ethyl-1-methyl-2-oxo-propyl)-4-methyl-benzamid.

40

## Synthesebeispiele

Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangs-

45 verbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die

## 22

so erhaltenen Verbindungen sind in den anschließenden Tabellen mit physikalischen Angaben aufgeführt.

Beispiel 1: 6-Chlor-5-(2,4,6-trifluorphenyl)-4-isopropyl-  
5 amino-2-(2-pyridyl)-pyrimidin [I-1]

a) 4,6-Dihydroxy-5-(2,4,6-trifluorphenyl)-2-(2-pyridyl)-pyrimidin

332 g (1,16 mol) 2-(2,4,6-Trifluorphenyl)malonsäurediethylester  
10 und 192 g (1,04 mol) Tributylamin wurden zusammen mit 182 g  
(1,17 mol) Pyridin-2-carboxamidin für acht Std. auf 180°C erhitzt.  
Dabei destillierte das entstehende Ethanol ab. Anschließend lies  
~~man auf 60-70°C abkühlen und versetzte mit einer Lösung von 116 g~~  
(2,89 mol) Natriumhydroxid in 1200 ml Wasser. Nach 30 min. Rühren  
15 und Abkühlen auf etwa 20-25°C wurde mit Methyl-tert-butylether  
(MTBE) extrahiert und nach Phasentrennung die Wasserphase mit 6N  
Salzsäure angesäuert. Nach Abfiltrieren und Trocknen wurden 180 g  
der Titelverbindung erhalten.

<sup>1</sup>H-NMR: δ (ppm, DMSO-d<sub>6</sub>) = 8,75 (d); 8,3 (d); 8,1 (t); 7,6 (m);  
20 7,1 (t).

b) 4,6-Dichlor-5-(2,4,6-trifluorphenyl)-2-(2-pyridyl)-pyrimidin

Ein Suspension von 80,4 g (0,252 mol) des Pyrimidins aus Bsp. 1a  
25 in 515 g (3,36 mol) Phosphoroxychlorid wurde für 8 Std. auf 120°C  
erhitzt, dann im Vakuum einengt. Der Rückstand wurde in Dichlor-  
methan und Wasser aufgenommen. Nach Phasentrennung wurde die or-  
ganische Phase getrocknet und vom Lösungsmittel befreit. Nach  
Chomatographie an Kieselgel (Cyclohexan/Essigester) wurden 26 g  
30 der Tielverbindung erhalten.

<sup>1</sup>H-NMR: δ (ppm, CDCl<sub>3</sub>) = 8,9 (d); 8,6 (d); 7,8 (t); 7,5 (m); 6,8  
(t).

c) 6-Chlor-5-(2,4,6-trifluorphenyl)-4-isopropylamino-2-(2-pyrid-  
35 yl)-pyrimidin

Eine Lösung von 3,30 g (0,093 mol) des Dichlorids aus Bsp. 1b in  
4,5 ml Dimethylformamid (DMF) und 2,7 g (0,046 mol) Isopropylamin  
wurde 24 Std. bei 40°C gerührt. Nach Abkühlen auf 20-25°C wurde  
40 die Mischung mit Dichlormethan extrahiert, die organische Phase  
mit Wasser und ges. NaHCO<sub>3</sub>-Lösung gewaschen, dann getrocknet und  
vom Lösungsmittel befreit. Nach Chomatographie an Kieselgel (Cy-  
clohexan/Essigester) wurden 3,05 g der Tielverbindung erhalten.

<sup>1</sup>H-NMR: δ (ppm, CDCl<sub>3</sub>) = 8,8 (d); 8,4 (d); 7,8 (t); 7,4 (dd); 6,8  
45 (t); 4,5 (m); 4,4 (m); 1,4 (s); 1,25 (d).



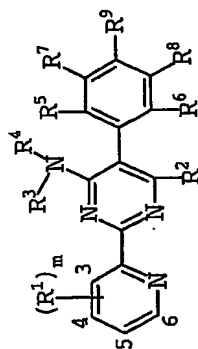


Tabelle I

Nr.	(R <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	(Fp. [°C], <sup>1</sup> H-NMR [ppm]; logP <sub>ow</sub> )	phys. Daten
I-1	H	Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	F	H	H	F		(Bsp. 1)
I-2	H	Cl	CH <sub>2</sub> C(=CH <sub>2</sub> )CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	F	H	H	H		logP <sub>ow</sub> 4,73
I-3	H	Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	Cl	F	H	H	H		logP <sub>ow</sub> 3,59
I-4	H	Cl	c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	H	Cl	F	H	H	H		152-156
I-5	H	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	F	H	H	H		logP <sub>ow</sub> 4,23
I-6	H	Cl	(S) CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	Cl	F	H	H	H		144-146
I-7	H	Cl	(R) CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	Cl	F	H	H	H		logP <sub>ow</sub> 4,8
I-8	H	Cl	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		Cl	F	H	H	H	0,9 (d, 3H); 1,1 (m, 2H); 1,6 (m, 3H); 2,9 (m, 2H); 4,1 (m, 2H); 7,1 (t, 1H); 7,4 (m, 2H); 7,8 (t, 1H); 8,4 (d, 1H); 8,9 (m, 1H)	
I-9	H	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	F		logP <sub>ow</sub> 4,08
I-10	H	Cl	(S) CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	F		logP <sub>ow</sub> 4,75

Nr.	(R <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	(Fp., [°C], <sup>1</sup> H-NMR [ppm]; logP <sub>ow</sub> )	phys. Daten
I-11	H	Cl	c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	H	F	F	H	H	F	1,8 (m, 2H); 7,8 (t, 1H); 1,4-1,7 (m, 4H), 2,1 (m, 2H); 4,6 (m, 2H); 6,9 (dd, 2H); 7,4 (m, 1H); 8,5 (d, 1H); 8,8 (d, 1H)	
I-12	H	Cl	(S) CH(CH <sub>3</sub> )CF <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	F		logP <sub>ow</sub> 4,5
I-13	H	Cl	(S) CH(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	F	H	H	F		187
I-14	H	Cl	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	F		162
I-15	H	Cl	(R) CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	F		139
I-16	H	Cl	(R) CH(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	F	H	H	F		185
I-17	6-CH <sub>3</sub>	Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	F	H	H	F		234-236
I-18	6-CH <sub>3</sub>	Cl	(S) CH(CH <sub>3</sub> )CF <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	F		238
I-19	6-CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	F	1,0 (t, 6H); 2,7 (s, 3H); 3,4 (q, 4H); 6,8 (m, 2H); 7,3 (d, 1H); 7,7 (t, 1H); 8,2 (d, 1H)	
I-20	6-CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	F		184
I-21	6-CH <sub>3</sub>	Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	F	1,1 (d, 6H); 2,55 (s, 3H); 2,7 (s, 3H); 4,8 (sept., 1H); 6,8 (dd, 2H); 7,3 (m, 1H); 7,7 (t, 1H); 8,2 (d, 1H)	

Nr.	(R <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	(Fp.[ <sup>13</sup> C], <sup>1</sup> H-NMR[ppm]); logPow	phys. Daten
I-22	6-CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	F	0,8 (d,6H); 1,0 (t,3H); 2,0 sept.,1H); 2,7 (s,3H); 3,2 (d,2H); 3,3 (q,2H); 6,8 (dd,2H); 7,3 (d,1H); 7,7 (t,1H); 8,13 (d,1H)	
I-23	6-CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> C(=CH <sub>2</sub> )CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	F	1,1 (t,3H); 1,45 (s,3H); 2,7 (s,3H); 3,4 (q,2H); 3,9 (s,2H); 4,8 (s,2H); 6,75 (dd,2H); 7,3 (m,1H); 7,7 (t,1H); 8,2 (d,1H)	
I-24	6-CH <sub>3</sub>	Cl	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		F	F	H	H	F	logPow 4,25	
I-25	6-CH <sub>3</sub>	Cl	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	F	187	
I-26	6-CH <sub>3</sub>	Cl	c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	H	F	F	H	H	F	235	
I-27	6-CH <sub>3</sub>	Cl	(R) CH(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	F	H	H	F	171	
I-28	6-CH <sub>3</sub>	Cl	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		F	F	H	H	F	0,9 (d,3H); 1,1 (m,2H); 1,6 (m,2H); 2,7 (s,3H); 2,8 (m,2H); 4,1 (m,2H); 6,8 (t,2H); 7,3 (m,1H); 7,7 (t,1H); 8,1 (d,1H)	
I-29	6-CH <sub>3</sub>	Cl	(S) CH(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	F	H	H	F	172	
I-30	6-CH <sub>3</sub>	Cl	(S) CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	F	187	
I-31	6-CH <sub>3</sub>	Cl	(R) CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	F	190	

Nr.	(R <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	(Fp. [ <sup>13</sup> C], <sup>1</sup> H-NMR [ppm]; logP <sub>ow</sub> )	phys. Daten
I-32	4-CH <sub>3</sub>	Cl	(S) CH(CH <sub>3</sub> )CF <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	F		203-205
I-33	4-CH <sub>3</sub>	Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	F		195-198
I-34	4-CH <sub>3</sub>	Cl	(S) CH(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	F	H	H	F		218-220
I-35	4-CH <sub>3</sub>	Cl	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		F	F	H	H	F		168-172
I-36	4-CH <sub>3</sub>	Cl	(S) CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	F		187-189
I-37	4-CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	F		145-147
I-38	4-CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	F		192-5
I-39	4-CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> C(=CH <sub>2</sub> )CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	F	1,1 (t,3H); 1,5 (s,3H); 2,45 (s,3H); 3,4 (q,2H); 3,9 (m,2H); 7,8 (m,2H); 6,8 (t,2H); 7,2 (m,1H); 8,2 (s,1H); 8,7 (m,1H)	
I-40	4-CH <sub>3</sub>	Cl	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	F		188-190
I-41	4-CH <sub>3</sub>	Cl	c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	H	F	F	H	H	F		195-198
I-42	4-CH <sub>3</sub>	Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	F		185-187
I-43	4-CH <sub>3</sub>	Cl	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		F	F	H	H	F		158-162
I-44	4-CH <sub>3</sub>	Cl	(R) CH(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	F	H	H	F		215-218
I-45	4-CH <sub>3</sub>	Cl	(R) CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	F		184-187
I-46	H	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		F	F	H	H	F		112-113
I-47	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	F		106-108

Nr.	(R <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	(Fp. [°C], <sup>1</sup> H-NMR[ppm]; logP <sub>ow</sub> )	phys. Daten
I-47-1	H	CH <sub>3</sub>	(R)CH(CH <sub>3</sub> )C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	F	0,9 (s, 3H); 4,2 (t, 2H); 8,5	9H; 1,1 (d, 3H); 2,3 (s, m, 1H); 4,4 (m, 1H); 6,9 (m, 1H); 7,4 (m, 1H); 7,9 (m, 1H); (d, 1H); 8,9 (m, 1H)
I-48	H	CH <sub>3</sub>	(R)CH(CH <sub>3</sub> )CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	F	H	H	F	0,9 (d, 1H); 2,3 (m, 1H); 7,8 (m, 1H)	6H; 1,1 (d, 3H); 1,8 (m, s, 3H); 4,2 (m, 1H); 4,4 (m, 1H); 6,9 (m, 2H); 7,4 (m, 1H); 7,8 (m, 1H); 8,4 (m, 1H); 8,8 (m, 1H)
I-49	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	F	1,0 (t, 4H); 6,8 (m, 1H); 0,9 (d, 1H); 2,3 (m, 1H); 7,8 (m, 1H)	6H; 2,3 (s, 3H); 3,4 (q, m, 2H); 7,4 (m, 1H); 7,8 (m, 1H); 8,4 (m, 1H); 8,8 (m, 1H); 1,1 (d, 3H); 1,8 (m, s, 3H); 4,2 (m, 1H); 4,4 (m, 1H); 6,8 (m, 2H); 7,4 (m, 1H); 7,8 (m, 1H); 8,4 (m, 1H); 8,8 (m, 1H)
I-50	H	CH <sub>3</sub>	(S)CH(CH <sub>3</sub> )CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	F	H	H	F	0,9 (d, 1H); 2,3 (m, 1H); 7,8 (m, 1H)	6H; 1,1 (d, 3H); 1,8 (m, s, 3H); 4,2 (m, 1H); 4,4 (m, 1H); 6,8 (m, 2H); 7,4 (m, 1H); 7,8 (m, 1H); 8,4 (m, 1H); 8,8 (m, 1H)
I-51	H	Cl	CH(CH <sub>3</sub> )CF <sub>3</sub>	H	Cl	F	H	H	H		150

Nr.	(R <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	(Fp.[PC], <sup>1</sup> H-NMR[ppm]; logP <sub>ow</sub> )	phys. Daten
I-52	H	Cl	CH <sub>2</sub> C(=CH <sub>2</sub> )CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	F	1,1 (t, 3H); 3,9 (s, 2H); 7,4 (m, 1H); 8,4 (d, 1H); 8,8 (d, 1H)	1,5 (s, 3H); 3,4 (q, s, 2H); 4,8 (s, 2H); 6,8 (t, 2H); 7,4 (m, 1H); 7,8 (t, 1H); 8,4 (d, 1H); 8,8 (d, 1H)
I-53	H	Cl	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	F	0,9 (d, 1H); 2,3 (s, 3H); 6,9 (m, 1H); 7,8 (m, 1H); 8,4 (m, 1H); 8,8 (m, 1H)	1,1 (d, 3H); 1,8 (m, s, 3H); 4,2 (m, 1H); 4,4 (s, 2H); 6,9 (m, 2H); 7,4 (m, 1H); 8,4 (m, 1H); 8,8 (m, 1H)
I-54	H	Cl	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	F		172-175
I-55	H	Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	F		158
I-56	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	F		200
I-57	H	Cl	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>		F	F	H	H	F	0,9 (d, 3H); 3,0 (t, 2H); 7,4 (m, 1H); 8,4 (m, 1H)	1,1 (m, 2H); 1,7 (m, t, 2H); 4,5 (d, 2H); 6,8 (t, 2H); 7,4 (m, 1H); 7,8 (m, 1H); 8,4 (m, 1H)
I-58	H	Cl	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>		F	F	H	H	OCH <sub>3</sub>		133-135
I-59	H	Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	F	H	H	OCH <sub>3</sub>		173-175
I-60	H	Cl	(R)CH(CH <sub>3</sub> )CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	F	H	H	OCH <sub>3</sub>		147-149
I-61	H	Cl	(R)CH(CH <sub>3</sub> )C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	OCH <sub>3</sub>		179-181
I-62	H	Cl	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	OCH <sub>3</sub>		142-144

Nr.	(R <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	(Fp. [°C], <sup>1</sup> H-NMR [ppm]; logP <sub>ow</sub> )	phys. Daten
I-63	H	Cl	CH <sub>2</sub> C(=CH <sub>2</sub> )CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	OCH <sub>3</sub>		135-137
I-64	H	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	OCH <sub>3</sub>		logP 5.0
I-65	H	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	OCH <sub>3</sub>		logP 4.0
I-66	H	Cl	c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	H	F	F	H	H	OCH <sub>3</sub>		173-175
I-67	H	Cl	(S)CH(CH <sub>3</sub> )CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	F	H	H	OCH <sub>3</sub>		145-146
I-68	H	Cl	(S)CH(CH <sub>3</sub> )C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	OCH <sub>3</sub>		185-187
I-69	H	Cl	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>		F	F	H	H	OH		185-187
I-70	H	Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	F	H	H	OH		log.P 3.0
I-71	H	Cl	(R)CH(CH <sub>3</sub> )CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	F	H	H	OH		173-175
I-72	H	Cl	(R)CH(CH <sub>3</sub> )C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	OH		175-177
I-73	H	Cl	CH <sub>2</sub> C(=CH <sub>2</sub> )CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	OH		135-137
I-74	H	Cl	(S)CH(CH <sub>3</sub> )CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	F	H	H	OH		110-112
I-75	H	Cl	(S)CH(CH <sub>3</sub> )C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	OH		109-110
I-76	H	Cl	c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	H	F	F	H	H	OH		128-130
I-77	H	Cl	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	OH		153-155

Nr.	(R <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	(Fp. [ <sup>13</sup> C], <sup>1</sup> H-NMR [ppm]; logP <sub>ow</sub> )	phys. Daten
I-78	H	Cl	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	F	F	H	H	OH	0,8 (d, 4H); 6,8 (m, 1H); 8,6 (d, 1H); 8,9 (m, 1H)	2H); 1,8 (m, 2H); 3,3 (m, (d, 2H); 7,6 (m, 1H); 8,0 (d, 1H); 8,6 (d, 1H); 8,9 (m, 1H)
I-79	H	Cl	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	OH	0,8 (d, 1H); 3,3 (d, 2H); 7,6 (m, 1H); 8,6 (d, 1H); 8,9 (m, 1H)	6H); 1,0 (t, 3H); 1,9 (m, (d, 2H); 3,5 (q, 2H); 6,8 (d, 1H); 8,0 (m, 1H); 8,6 (d, 1H); 8,9 (m, 1H)
I-80	H	Cl	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>		F	F	H	H	H	0,9 (d, 3H); 3,0 (t, 2H); 4,5 (d, 2H); 6,8 (t, 2H); 7,5 (m, 1H); 8,0 (m, 1H); 8,5 (t, 1H); 8,8 (d, 1H); 9,4 (d, 1H)	3H); 1,1 (m, 2H); 1,7 (m, (t, 2H); 4,5 (d, 2H); 6,8 (t, 2H); 7,5 (m, 1H); 8,0 (m, 1H); 8,5 (t, 1H); 8,8 (d, 1H); 9,4 (d, 1H)
I-81	H	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	H		logP 4.7
I-82	H	Cl	(S)CH(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	F	H	H	H		logP 5.0
I-83	H	Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	F	H	H	H		logP 4.1
I-84	H	Cl	(R)CH(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	F	H	H	H		logP 5.0
I-85	H	Cl	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>		CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>		90-94
I-86	H	Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	1,1 (d, 3H); 4,5 (d, 1H); 8,3 (t, 1H); 2,1 (s, 3H); 2,4 (s, (m, 1H); 4,9 (m, 1H); 7,0 (d, 1H); 7,1 (d, 1H); 7,8 (m, 1H); 8,7 (d, 1H); 9,2 (m, 1H)	6H); 2,1 (s, 3H); 2,4 (s, (m, 1H); 4,9 (m, 1H); 7,0 (d, 1H); 7,1 (d, 1H); 7,8 (m, 1H); 8,7 (d, 1H); 9,2 (m, 1H)



Nr.	(R <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	(Fp.) [ <sup>1</sup> H-NMR [ppm]; logP <sub>ow</sub>	phys. Daten
I-87	H	Cl	c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	1,2 (m, 2H); 2,1 (s, 3H); 4,7 (m, 1H); 7,0 (d, 1H); 8,2 (t, 1H); 8,2 (t, 1H); 8,7 (d, 1H); 9,2 (m, 1H)	1,6 (m, 2H); 1,7 (m, 2H); 2,2 (m, 2H); 2,5 (s, 3H); 4,7 (m, 1H); 5,0 (m, 1H); 7,1 (d, 1H); 7,8 (t, 1H); 8,7 (d, 1H); 9,2 (m, 1H)
I-88	H	Cl	(S)CH(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	0,9 (dd, 1H); 2,1 (m, 2H); 7,8 (m, 1H)	1,1 (d, 3H); 1,8 (m, 6H); 2,4 (s, 3H); 4,5 (d, 1H); 7,0 (d, 1H); 7,1 (d, 1H); 8,3 (m, 1H); 8,7 (m, 1H); 9,2 (m, 1H)
I-89	H	Cl	(R)CH(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	0,9 (dd, 1H); 2,1 (m, 1H); 7,1 (m, 1H); 8,7 (m, 1H)	1,1 (d, 3H); 1,8 (m, 6H); 2,4 (s, 3H); 4,5 (d, 1H); 7,0 (d, 1H); 7,1 (d, 1H); 8,3 (m, 1H); 8,7 (m, 1H); 9,2 (m, 1H)
I-90	H	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>		logP 4.6
I-91	H	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	1,0 (t, 3H); 3,4 (m, 3H); 8,4	2,0 (s, 3H); 2,4 (s, 3H); 4,5 (m, 2H); 7,1 (m, 1H); 7,8 (t, 1H); 8,8 (d, 1H)
I-92	H	Cl	(R)CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	0,8 (s, 3H); 4,4 (m, 3H); 8,4	1,1 (dd, 3H); 2,4 (s, 3H); 4,6 (t, 1H); 7,1 (m, 1H); 7,8 (t, 1H); 8,8 (m, 1H)

Nr.	(R <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	(Fp. [ <sup>13</sup> C], <sup>1</sup> H-NMR [ppm]; logP <sub>ow</sub> )	phys. Daten
I-93	H	Cl	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>		F	F	H	H	CN	0,9 (d, 3H); 2,8 (m, 2H); 7,4 (m, 1H); 8,4 (d, 1H); 8,8 (m, 1H)	1,1 (m, 2H); 1,6 (m, 2H); 3,9 (m, 2H); 7,3 (m, 1H); 7,8 (m, 1H)
I-94	H	Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	H	H	H	CH <sub>3</sub>		logP 4.8
I-95	H	Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	H	H	H	CH <sub>3</sub>	1,2 (d, 2H); 2,4 (m, 1H); 8,4 (q, 1H)	1,6 (m, 2H); 3,0 (m, 2H); 4,8 (m, 3H); 7,0 (m, 3H); 7,9 (m, 1H); 8,7 (d, 1H); 9,2 (m, 1H)
I-96	H	Cl	(S)CH(CH <sub>3</sub> )CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	H	H	H	CH <sub>3</sub>	0,9 (dd, 1H); 2,4 (m, 3H); 8,7 (d, 1H); 9,2 (d, 1H)	1,1 (d, 3H); 1,8 (m, 6H); 4,8 (m, 2H); 7,1 (s, 3H); 7,8 (t, 1H); 8,4 (t, 1H)
I-97	H	Cl	(R)CH(CH <sub>3</sub> )CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	H	H	H	CH <sub>3</sub>	0,9 (dd, 1H); 2,4 (m, 1H); 8,1 (t, 1H)	1,1 (d, 3H); 1,8 (m, 6H); 4,5 (m, 1H); 4,6 (s, 3H); 7,1 (m, 3H); 7,6 (t, 1H); 8,6 (d, 1H); 9,0 (d, 1H)
I-98	H	Cl	(S)CH(CH <sub>3</sub> )C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	F	H	H	H	CH <sub>3</sub>	0,8 (s, 3H); 4,4 (m, 3H); 8,4 (d, 1H)	1,1 (dd, 3H); 2,4 (s, 3H); 4,6 (t, 1H); 7,1 (m, 1H); 7,4 (m, 1H); 7,8 (t, 1H); 8,8 (m, 1H)
I-99	H	Cl	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>		F	H	H	H	CH <sub>3</sub>		172-174

Nr.	(R <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	(Fp-[ <sup>10</sup> Cl, <sup>1</sup> H-NMR[ppm]; logP <sub>ow</sub> )	phys. Daten
I-100	H	Cl	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	F	H	H	H	CH <sub>3</sub>	0,9 (m, 3H); 4,6 (m, 1H); 7,8 (t, 1H); 8,2 (t, 1H); 8,7 (d, 1H); 9,1 (m, 1H)	1,2 (d, 3H); 2,4 (s, 3H); 4,7 (m, 1H); 7,1 (m, 1H); 7,8 (t, 1H); 8,2 (t, 1H); 8,7 (d, 1H); 9,1 (m, 1H)
I-101	H	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	H	H	H	CH <sub>3</sub>	1,0 (t, 4H); 7,1 (t, 1H); 8,7 (d, 1H); 9,2 (m, 1H)	2,4 (s, 3H); 3,5 (m, 3H); 7,8 (t, 1H); 8,4 (m, 1H); 8,7 (d, 1H); 9,2 (m, 1H)
I-102	H	Cl	c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	H	F	H	H	H	CH <sub>3</sub>	1,4 (m, 2H); 4,8 (t, 1H); 8,2 (t, 1H); 8,7 (d, 1H); 9,1 (m, 1H)	1,6 (m, 4H); 2,2 (m, 2H); 7,1 (m, 3H); 7,8 (t, 1H); 8,2 (t, 1H); 8,7 (d, 1H); 9,1 (m, 1H)
I-103	H	Cl	CH <sub>2</sub> C(=CH <sub>2</sub> )CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	H	H	H	CH <sub>3</sub>	1,0 (t, 3H); 3,4 (m, 2H); 7,4 (m, 1H); 8,8 (d, 1H)	1,4 (s, 3H); 2,4 (s, 3H); 3,9 (m, 2H); 4,8 (m, 2H); 7,0 (m, 2H); 7,1 (t, 1H); 7,8 (t, 1H); 8,4 (d, 1H); 8,8 (d, 1H)
I-104	H	Cl	CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	F	H	H	H	CH <sub>3</sub>	0,8 (s, 3H); 4,4 (m, 3H); 8,4 (d, 1H)	1,3 (s, 3H); 2,4 (s, 3H); 4,6 (m, 1H); 7,1 (m, 1H); 7,8 (t, 1H); 8,8 (d, 1H)
I-105	H	Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	H	H	F	1,2 (d, 1H); 4,8 (m, 1H); 8,1 (m, 1H); 9,1 (m, 1H)	2,1 (s, 3H); 4,4 (m, 1H); 7,1 (m, 3H); 7,6 (m, 1H); 8,1 (m, 1H); 8,6 (m, 1H); 9,1 (m, 1H)

Nr.	(R <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	(Fp. [°C], <sup>1</sup> H-NMR[ppm]; logP <sub>ow</sub> )	phys. Daten
I-106	H	Cl	CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	H	H	F	1,2 (m, 2H); 2,1 (m, 1H); 7,8 (t, 1H)	3H; 1,6 (m, 2H); 1,8 (m, 3H); 2,9 (m, 2H); 5,1 (s, 3H); 7,0 (m, 2H); 7,3 (m, 1H); 8,3 (t, 1H); 8,7 (d, 1H); 9,3 (m, 1H)
I-107	H	Cl	(S)CH(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	H	H	F		51-52
I-108	H	Cl	(R)CH(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	H	H	F	0,8 (d, 1H); 2,1 (m, 3H); 8,4	6H; 1,1 (d, 3H); 1,8 (m, 3H); 4,3 (m, 2H); 7,1 (m, 1H); 7,4 (m, 1H); 7,8 (t, 1H); 8,8 (d, 1H)
I-109	H	Cl	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>		CH <sub>3</sub>	H	H	H	F	0,9 (d, 4H); 2,2 (m, 1H); 7,1 (m, 1H); 8,7	3H; 1,0 (m, 2H); 1,6 (m, 3H); 2,8 (t, 2H); 4,2 (s, 3H); 4,3 (m, 1H); 7,0 (m, 2H); 7,8 (t, 1H); 8,3 (t, 1H); 9,2 (m, 1H)
I-110	H	Cl	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	H	H	F	0,9 (t, 2H); 2,2 (m, 3H); 8,4	3H; 1,2 (d, 3H); 1,4 (m, 3H); 4,3 (m, 2H); 7,1 (s, 3H); 7,4 (m, 1H); 7,8 (t, 1H); 8,8 (m, 1H)
I-111	H	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	F	1,0 (t, 4H); 7,0 (m, 1H)	6H; 2,2 (s, 3H); 3,3 (m, 3H); 7,2 (m, 1H); 7,4 (m, 1H); 7,8 (t, 1H); 8,4 (d, 1H); 8,8 (m, 1H)

Nr.	(R <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	(Fp. [ <sup>o</sup> Cl], <sup>1</sup> H-NMR [ppm]; logP <sub>ow</sub> )	phys. Daten
I-112	H	Cl	c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	H	H	F	1,3 (m, 5H); 4,6 (m, 3H); 8,7	2H); 1,6 (m, 4H); 2,2 (m, 1H); 5,0 (m, 1H); 7,1 (t, 1H); 8,3 (t, 1H); (d, 1H); 9,2 (m, 1H)
I-113	H	Cl	(R)CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	H	H	F		162-164
I-114	H	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	H	H	F		logP 4.1
I-115	4-CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	F	0,8 (t, 3H); 3,2 (m, 2H); 3,4 (q, 2H); 7,2 (m, 1H); 8,2 (s, 1H); 8,7 (d, 1H)	6H); 1,0 (t, 3H); 2,5 (s, 1H); 3,4 (q, 2H); 6,8 (t, 2H); 8,7 (d, 1H)
I-116	3-CH <sub>3</sub>	Cl	(S)CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	F		128-132
I-117	3-CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	F		logP 4.6
I-118	3-CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	F		198
I-119	3-CH <sub>3</sub>	Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	F		94-96
I-120	3-CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	F	0,8 (d, 1H); 2,5 (q, 2H); 7,6	6H); 1,0 (t, 3H); 1,9 (m, 1H); 3,1 (d, 2H); 3,3 (q, 2H); 6,8 (t, 2H); 7,2 (m, 1H); (d, 1H); 8,6 (d, 1H)
I-121	3-CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> C(=CH <sub>2</sub> )CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	F	1,0 (t, 3H); 3,3 (d, 2H); 7,6	3H); 1,5 (s, 3H); 2,5 (s, 1H); 3,8 (s, 2H); 4,8 (t, 2H); 7,2 (m, 1H); (d, 1H); 8,6 (d, 1H)
I-122	3-CH <sub>3</sub>	Cl	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>		F	F	H	H	F		122-127

Nr.	(R <sup>1</sup> ) <sub>m</sub>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	(Fp. [°C], 1H-NMR [ppm]; logP <sub>ow</sub> )	phys. Daten
I-123	3-CH <sub>3</sub>	Cl	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	F		154
I-124	3-CH <sub>3</sub>	Cl	(S)CH(CH <sub>3</sub> )CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	F	H	H	F		161
I-125	3-CH <sub>3</sub>	Cl	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>		F	F	H	H	F		130-132
I-126	3-CH <sub>3</sub>	Cl	c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	H	F	F	H	H	F		161-163
I-127	3-CH <sub>3</sub>	Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		F	F	H	H	F		144-148
I-128	3-CH <sub>3</sub>	Cl	(R)CH(CH <sub>3</sub> )C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	F		134-138
I-129	3-CH <sub>3</sub>	Cl	(R)CH(CH <sub>3</sub> )CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	F	F	H	H	F		159
I-130	3-CH <sub>3</sub>	Cl	(S)CH(CH <sub>3</sub> )CF <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	F		172

## 37

Die Bestimmung der Lipophilieparameter  $\log P_{ow}$  (Tabelle I) erfolgte gemäß der OECD-Prüfrichtlinie nach der RP-HPLC-Laufzeitmethode.

Dazu wurde eine Korrelationskurve  $\log k' / \log P_{ow}$  basierend auf zehn  
 5 Referenzsubstanzen erstellt und mit Hilfe der durch die Extraktionsmethode ermittelten Lipophilieparameter von acht Vergleichssubstanzen validiert.

Als stationäre Phase wurde eine handelsübliche  $C_{18}$ -Umkehrphase  
 10 verwendet. Die chromatographische Trennung erfolgte mit Methanol und einer Pufferlösung als mobile Phase bei pH 7,4 unter isokratischen Bedingungen.

Die Retentionszeiten der Referenzen  $t_R$  wurden gemäß Gleichung  $\Phi$  in  
 15 die Kapazitätsfaktoren  $k'$  überführt, wobei  $t_0$  als Retentionszeit des an der  $C_{18}$ -Umkehrphase unretardierten Lösungsmittels die Totzeit des chromatographischen Systems darstellt:

$$20 \quad k' = \frac{t_R - t_0}{t_0} \quad \Phi$$

Die lineare Korrelation der  $\log k'$ - mit den im Anhang zur Richtlinie 92/69/EWG publizierten  $\log P_{ow}$ -Werten der Referenzen liefert  
 25 die Korrelationskurve durch lineare Regression.

Die Lipophilieparameter  $\log P_{ow}$  der Analyten wurden nach Berechnung des logarithmierten Kapazitätsfaktors  $\log k'$  aus der Korrelationskurve der Referenzen interpoliert.

30

Die Valierung der beschriebenen RP-HPLC-Analysenmethode und der verwendeten Referenzen erfolgt mit Hilfe von acht Vergleichswirkstoffen, deren Verteilungsverhalten mit Hilfe der Extraktionsmethode bestimmt worden ist.

35

Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der allgemeinen Formel I ließ sich durch die folgenden Versuche zeigen:

40

Die Wirkstoffe wurden getrennt oder gemeinsam als 10%ige Emulsion in einem Gemisch aus 70 Gew.-% Cyclohexanon, 20 Gew.-% Nekanil® LN (Lutensol® AP6, Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) und 10 Gew.-% Wettol®  
 45 EM (nichtionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Ricinusöl) aufbereitet und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

## 38

Anwendungsbeispiel 1 - Wirksamkeit gegen *Alternaria solani* an Tomaten

- Blätter von Topfpflanzen der Sorte "Große Fleischtomate St. Pierre" wurden mit einer wäßrigen Suspension, die aus einer Stammlösung aus 10 % Wirkstoff, 63 % Cyclohexanon und 27 % Emulgiermittel angesetzt wurde, bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag wurden die Blätter mit einer wäßrigen Zoosporenaufschwemmung von *Alternaria solani* in 2 % Biomalzlösung mit einer Dichte von  $0,17 \times 10^6$  Sporen/ml infiziert. Anschließend wurden die Pflanzen in einer wasserdampfgesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 20 und 22°C aufgestellt. Nach 5 Tagen hatte sich die Krautfäule auf den unbehandelten, jedoch infizierten Kontrollpflanzen so stark entwickelt, daß der Befall visuell in % ermittelt werden konnte.

- In diesem Test zeigten die mit 63 ppm der Wirkstoffe I-1 bis I-7, I-9 bis I-16, I-20, I-24, I-25, I-32, I-33, I-51, I-54, I-58, I-59, I-62, I-63, I-64, I-66, I-67, I-68 und I-94 behandelten Pflanzen maximal 3 % Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 100 % befallen waren.

Anwendungsbeispiel 2: Wirksamkeit gegen *Botrytis cinerea* an Paprikablättern

- Paprikasämlinge der Sorte "Neusiedler Ideal Elite" wurden, nachdem sich 4 bis 5 Blätter gut entwickelt hatten, mit einer wässrigen Wirkstoffaufbereitung, die aus einer Stammlösung bestehend aus 10 % Wirkstoff, 85 % Cyclohexanon und 5 % Emulgiermittel angesetzt wurde, bis zur Tropfnässe besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Botrytis cinerea*, die  $1,7 \times 10^6$  Sporen/ml in einer 2 %igen wässrigen Biomalzlösung enthielt, inokuliert. Anschließend wurden die Versuchspflanzen in eine Klimakammer mit 22 bis 24°C und hoher Luftfeuchtigkeit gestellt. Nach 5 Tagen konnte das Ausmaß des Pilzbefall auf den Blättern visuell in % ermittelt werden.

- In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe I-1 bis I-7, I-9 bis I-14, I-20, I-24, I-32 bis I-41, I-43, I-51, I-53, I-55, I-56, I-57, I-58, I-59, I-62, I-63, I-64, I-66, I-67, I-68, I-82, I-83, I-86, I-87, I-88, I-90 und I-115 bis zu 5 % Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 90 % befallen waren.



## 39

Anwendungsbeispiel 3: Protektive Wirksamkeit gegen den durch *Sphaerotheca fuliginea* verursachten Gurkenmehltau

Blätter von in Töpfen gewachsenen Gurkenkeimlingen der Sorte  
5 "Chinesische Schlange" wurden im Keimblattstadium mit wässriger  
Wirkstoffaufbereitung, die aus einer Stammlösung bestehend aus  
10 % Wirkstoff, 85 % Cyclohexanon und 5 % Emulgiermittel ange-  
setzt wurde, bis zur Tropfnässe besprüht. 20 Stunden nach dem An-  
trocknen des Spritzbelages wurden die Pflanzen mit einer wässri-  
10 gen Sporensuspension des Gurkenmehltaus (*Sphaerotheca fuliginea*)  
inokuliert. Anschließend wurden die Pflanzen im Gewächshaus bei  
Temperaturen zwischen 20 und 24°C und 60 bis 80 % relativer Luft-  
~~feuchtigkeit für 7 Tage kultiviert. Dann wurde das Ausmaß der~~  
Mehltauentwicklung visuell in %-Befall der Keimblattfläche ermit-  
15 telt.

In diesem Test zeigten die mit 63 ppm der Wirkstoffe I-1, I-3,  
I-5 bis I-10, I-12, I-13, I-16, I-18, I-21, I-32, I-33, I-51,  
I-52, I-54, I-55, I-56, I-58, I-59, I-62, I-63, I-64, I-66, I-67,  
20 I-68 und I-83 maximal 10 % Befall, während die unbehandelten  
Pflanzen zu 100 % befallen waren.

Anwendungsbeispiel 4 - Wirksamkeit gegen die Netzfleckenkrankheit  
der Gerste

25

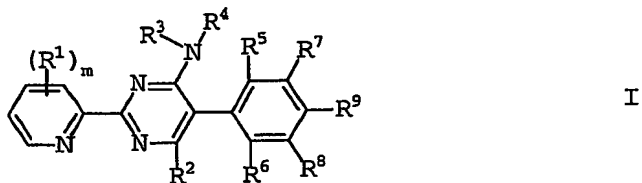
Blätter von in Töpfen gewachsenen Gerstenkeimlingen der Sorte  
"Igri" wurden mit wässriger Wirkstoffaufbereitung, die aus einer  
Stammlösung bestehend aus 10 % Wirkstoff, 63 % Cyclohexanon und  
27 % Emulgiermittel angesetzt wurde, bis zur Tropfnässe besprüht  
30 und 24 Stunden nach dem Antrocknen des Spritzbelages mit einer  
wässrigen Sporensuspension von *Pyrenophora [syn. Drechslera] te-*  
*res*, dem Erreger der Netzfleckenkrankheit inokuliert. Anschlie-  
ßend wurden die Versuchspflanzen im Gewächshaus bei Temperaturen  
zwischen 20 und 24°C und 95 bis 100 % relativer Luftfeuchtigkeit  
35 aufgestellt. Nach 6 Tagen wurde das Ausmaß der Krankheitsentwick-  
lung visuell in % Befall der gesamten Blattfläche ermittelt.

In diesem Test zeigten die mit 63 ppm der Wirkstoffe I-1 bis I-6,  
I-10, I-12 bis I-14, I-32, I-33, I-38, I-43, I-51, I-56, I-64 und  
40 I-86 behandelten Pflanzen nicht über 15 % Befall, während die un-  
behandelten Pflanzen zu 90 % befallen waren.

45

## Patentansprüche

1. 2-(2-Pyridyl)-5-phenyl-6-aminopyrimidine der Formel I,



in der die Substituenten und der Index folgende Bedeutung haben:

15	R <sup>1</sup>	Halogen, Hydroxy, Cyano, Oxo, Nitro, Amino, Mercapto, C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Alkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Halogenalkyl, C <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> -Alkenyl, C <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> -Alkynyl, C <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> -Cycloalkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Alkoxy, C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Halogenalkoxy, Carboxyl, C <sub>1</sub> -C <sub>7</sub> -Alkoxycarbonyl, Carbamoyl, C <sub>1</sub> -C <sub>7</sub> -Alkylaminocarbonyl, C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Alkyl-C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -alkylaminocarbonyl, Morpholinocarbonyl, Pyrrolidinocarbonyl, C <sub>1</sub> -C <sub>7</sub> -Alkylcarbonylamino, C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Alkylamino, Di-(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -alkyl)amino, C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Alkylthio, C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Alkylsulfinyl, C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Alkylsulfonyl, Hydroxysulfonyl, Aminosulfonyl, C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Alkylaminosulfonyl, Di-(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -alkyl)aminosulfonyl;
25	m	0, 1, 2, 3 oder 4;
30	R <sup>2</sup>	Wasserstoff, Halogen, Cyano, C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Alkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Halogenalkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Alkoxy, C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Halogenalkoxy oder C <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> -Alkenyloxy;
35	R <sup>3</sup> , R <sup>4</sup>	unabhängig voneinander Wasserstoff, C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Alkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Halogenalkyl, C <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> -Cycloalkyl, C <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> -Halogen-cycloalkyl, C <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> -Alkenyl, C <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> -Halogenalkenyl, C <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> -Cycloalkenyl, C <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> -Alkynyl, C <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> -Halogenalkynyl oder C <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> -Cycloalkynyl,
40		R <sup>3</sup> und R <sup>4</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch ein Atom aus der Gruppe O, N oder S unterbrochen sein und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Alkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Halogenalkyl oder Oxy-C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> -alkylenoxy tragen kann oder in dem zwei benachbarte C-Atome oder ein N- und ein benachbartes C-Atom durch
45		eine C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkylenkette verbunden sein können;

## 41

- 5      R<sup>5</sup>      Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl;
- R<sup>6</sup>      Wasserstoff oder eine der bei R<sup>5</sup> genannten Gruppen;
- R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>    unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen,  
                 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl;
- R<sup>9</sup>      Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl,  
                 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy,  
10            C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminocarbonyl.

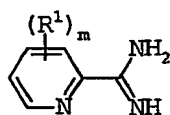
2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, wobei m für null  
~~oder 1, 2 oder 3 steht und R<sup>1</sup> folgende Bedeutung hat:~~

- 15      Halogen, Hydroxy, Cyano, Nitro, Amino, Mercapto, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl,  
         C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cyclo-  
         alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, Carboxyl,  
         C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-Alkoxycarbonyl, Carbamoyl, C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-Alkylaminocarbonyl,  
         C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylaminocarbonyl, Morpholinocarbonyl, Pyr-  
20      roolidinocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-Alkylcarbonylamino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino,  
         Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl,  
         C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, Hydroxysulfonyl, Aminosulfonyl,  
         C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminosulfonyl oder Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)aminosulfonyl;
- 25 3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 2, wobei die Varia-  
      blen folgende Bedeutung haben
- R<sup>2</sup>      Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy;
- 30      R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>    unabhängig voneinander Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl,  
                 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl oder  
                 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl;
- 35            R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoff-  
                 atom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder  
                 sechsgliedrigen Ring bilden, der durch ein Sauer-  
                 stoffatom unterbrochen sein und einen C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsub-  
                 stituenten tragen kann;
- 40      R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>    unabhängig voneinander Halogen;
- R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>    unabhängig voneinander Wasserstoff oder Halogen;
- R<sup>9</sup>      Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy oder  
45            C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl.

## 42

4. Verbindungen der Formel I gemäß Ansprüchen 1 bis 3, wobei R<sup>2</sup> Chlor bedeutet.
5. Verbindungen der Formel I gemäß Ansprüchen 1 bis 4, wobei die Kombination der Substituenten R<sup>5</sup> bis R<sup>9</sup> für folgende Bedeutungen steht: 2-Methyl,4-Fluor, 2-Fluor,4-Methyl, 2,4-Dimethyl, 2-Chlor,6-Fluor; 2,6-Difluor; 2,6-Dichlor; 2-Methyl,6-Fluor; 2,4,6-Trifluor; 2,6-Difluor, 4-Methoxy und Pentafluor.
- 10 6. Verfahren zur Herstellung von 5-Phenylpyridinen der Formel I gemäß Ansprüchen 1 bis 5, in denen R<sup>2</sup> für Chlor steht, dadurch gekennzeichnet, daß man 2-Pyridylamide der Formel II,

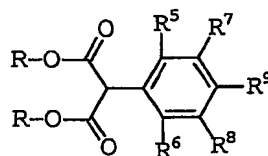
15



II

mit Phenylmalonaten der Formel III,

20

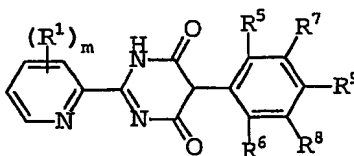


III

25

in der R für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl steht, zu Verbindungen der Formel IV,

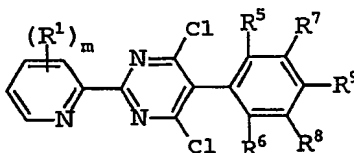
30



IV

umsetzt, welche mit Chlorierungsmitteln in die Dichlorpyrimidine der Formel V

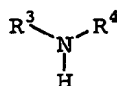
35



V

40

überführt werden, die mit Aminen der Formel VI



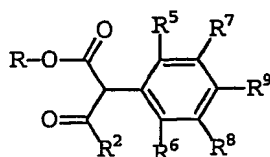
VI

45

zu den Pyrimidinderivaten der Formel I, in der R<sup>2</sup> für Chlor steht, umgesetzt werden.

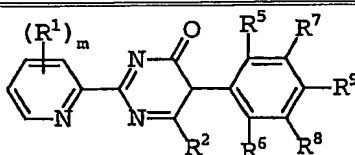
## 43

7. Verfahren zur Herstellung von 5-Phenylpyridinen der Formel I gemäß Ansprüchen 1 bis 5, in denen R<sup>2</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl steht, dadurch gekennzeichnet, daß man ein 2-Pyridylamidin der Formel II gemäß Anspruch 6, mit Phenyl-β-ketoestern der Formel VII,



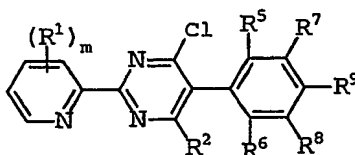
VII

in der R für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl steht, zu Verbindungen der Formel IVa



IVa

umsetzt, welche mit Chlorierungsmitteln in die Chlorpyrimidine der Formel Va



Va

überführt werden, die mit Aminen VI gemäß Anspruch 6 zu den Pyrimidinderivaten der Formel I, in der R<sup>2</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl steht, umgesetzt werden.

8. Zwischenprodukte der Formeln IV und V gemäß Anspruch 6, wobei die Kombination der Substituenten R<sup>5</sup> bis R<sup>9</sup> die Bedeutungen gemäß Anspruch 5 aufweisen.
9. Zwischenprodukte der Formeln IVa und Va gemäß Anspruch 7, wobei die Kombination der Substituenten R<sup>5</sup> bis R<sup>9</sup> die Bedeutungen gemäß Anspruch 5 aufweisen.
10. Zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen geeignetes Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß Ansprüchen 1 bis 5.
11. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Ansprüchen 1 bis 5 behandelt.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/03/01162

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER  
 IPC 7 C07D401/04 A01N43/54

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

CHEM ABS Data, EPO-Internal

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 5 250 530 A (W.GIENCKE) 5 October 1993 (1993-10-05) claims 1,3; table A	1, 10, 11
A	H.-J. KABBE: "SUBSTITUIERTE 4-HYDROXY- UND 4-AMINO-PYRIMIDINE" LIEBIGS ANNALEN DER CHEMIE., vol. 704, 1967, pages 144-9, XP002243074 VERLAG CHEMIE GMBH. WEINHEIM., DE ISSN: 0170-2041 page 144 -page 148	1, 6, 7



Further documents are listed in the continuation of box C.



Patent family members are listed in annex.

## \* Special categories of cited documents :

- \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- \*E\* earlier document but published on or after the international filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- \*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- \* & \* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

2 June 2003

Date of mailing of the international search report

18/06/2003

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
 NL - 2280 HV Rijswijk  
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
 Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Francois, J

### Information on patent family members

PCT/03/01162

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES  
IPK 7 C07D401/04 A01N43/54

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

**B. RESEARCHIERTE GEBIETE**

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der Internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

CHEM ABS Data, EPO-Internal

**C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN**

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	US 5 250 530 A (W.GIENCKE) 5. Oktober 1993 (1993-10-05) Ansprüche 1,3; Tabelle A	1,10,11
A	H.-J. KABBE: "SUBSTITUIERTE 4-HYDROXY- UND 4-AMINO-PYRIMIDINE" LIEBIGS ANNALEN DER CHEMIE., Bd. 704, 1967, Seiten 144-9, XP002243074 VERLAG CHEMIE GMBH. WEINHEIM., DE ISSN: 0170-2041 Seite 144 -Seite 148	1,6,7

☐ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

\*A\* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

\*E\* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

\*L\* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

\*O\* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

\*P\* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

\*T\* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

\*X\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

\*Y\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann nahellegend ist

\*Z\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

2. Juni 2003

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

18/06/2003

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Francois, J



Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

PCT/03/01162

Formblatt PCT/ISA/210 (Anhang Patentfamilie)(Juli 1992)

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

**BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ **BLACK BORDERS**
- ☐ **IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- ☐ **FADED TEXT OR DRAWING**
- ☐ **BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- ☐ **SKEWED/SLANTED IMAGES**
- ☐ **COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- ☐ **GRAY SCALE DOCUMENTS**
- ☒ **LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- ☐ **REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- ☐ **OTHER:** \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**